

**2020年9月改訂 (第17版)
*2019年4月改訂

処方箋医薬品
注意—医師等の処方箋により
使用すること
処方箋医薬品
注意—医師等の処方箋により
使用すること

合成セファロスポリン製剤

セファメジン[®]α点滴用キット1g
セファメジン[®]α点滴用キット2g

注射用セファゾリンナトリウム水和物

Cefamezin[®]α 1g・2g for Infusion Kit

日本標準商品分類番号
876132

	1g	2g
承認番号	21800AMX10309	21800AMX10310
薬価収載	2006年6月	
販売開始	1999年7月	
再評価結果	2004年9月	

貯 法：室温保存
使用期限：ケース等に表示 (製造後2年)

* **【禁忌 (次の患者には投与しないこと)】**
本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

* **【原則禁忌 (次の患者には投与しないことを原則とするが、特に必要とする場合には慎重に投与すること)】**
セフェム系抗生物質に対し過敏症の既往歴のある患者

【組成・性状】

1. 組成

セファメジンα点滴用キット1g、2gは用時溶解用の粉末注射剤と溶解液からなり、下表の有効成分を含有する。

	粉末注射剤 (1薬剤用容器中)	溶解液 (1溶解液用容器中)
セファメジンα 点滴用キット1g (生理食塩液添付)	日局 セファゾリンナトリウム 水和物 1g (力価)	日局 生理食塩液 100mL
セファメジンα 点滴用キット2g (生理食塩液添付)	日局 セファゾリンナトリウム 水和物 2g (力価)	日局 生理食塩液 100mL

2. 製剤の性状

本品は、薬剤用容器と溶解液用容器を組み合わせたもので、用時、連通部を開放し、薬剤を溶解できるようにしたものである。本品の薬剤用容器の内容物は、白色～微帯黄白色の結晶であり、溶解液用容器の内容物は、無色澄明の液である。溶解液に溶解したときのpH及び浸透圧比は下表のとおりである。

容器：プラスチックバッグ

含量/溶解液量	溶解液	pH	浸透圧比*
1g(力価)/100mL	日局 生理食塩液	4.6~6.3	約1
2g(力価)/100mL	日局 生理食塩液	4.6~6.3	約1

※生理食塩液に対する比

【効能・効果】

〈適応菌種〉

セファゾリンに感性的ブドウ球菌属、レンサ球菌属、肺炎球菌、大腸菌、肺炎桿菌、プロテウス・ミラビリス、プロビデンシア属

〈適応症〉

敗血症、感染性心内膜炎、表在性皮膚感染症、深在性皮膚感染症、リンパ管・リンパ節炎、慢性膿皮症、外傷・熱傷及び手術創等の二次感染、びらん・潰瘍の二次感染、乳腺炎、骨髄炎、関節炎、咽頭・喉頭炎、扁桃炎、急性気管支炎、肺炎、肺膿瘍、膿胸、慢性呼吸器病変の二次感染、膀胱炎、腎盂腎炎、腹膜炎、胆嚢炎、胆管炎、バルトリン腺炎、子宮内感染、子宮付属器炎、子宮旁結合織炎、眼内炎 (全眼球炎を含む)、中耳炎、副鼻腔炎、化膿性唾液腺炎

** **〈効能又は効果に関連する使用上の注意〉**
咽頭・喉頭炎、扁桃炎、急性気管支炎、中耳炎、副

鼻腔炎への使用にあたっては、「抗微生物薬適正使用の手引き」¹⁾を参照し、抗菌薬投与の必要性を判断した上で、本剤の投与が適切と判断される場合に投与すること。

【用法・用量】

セファゾリンとして、通常、1日量成人には1g (力価)、小児には体重kg当り20~40mg (力価)を2回に分けて点滴静注する。症状及び感染菌の感受性から効果不十分と判断される場合には、1日量成人1.5~3g (力価)を、小児には体重kg当り50mg (力価)を3回に分割投与する。症状が特に重篤な場合には、1日量成人5g (力価)、小児には体重kg当り100mg (力価)までを分割投与することができる。

〈用法・用量に関連する使用上の注意〉

- (1)本剤の使用にあたっては、耐性菌の発現等を防ぐため、原則として感受性を確認し、疾病の治療上必要な最小限の期間の投与にとどめること。
- (2)高度の腎障害のある患者では、血中濃度が持続するので、腎障害の程度に応じて投与量を減量し、投与の間隔をあけて使用すること。「(薬物動態)」の項参照)

【使用上の注意】

1. 慎重投与 (次の患者には慎重に投与すること)

- (1)ペニシリン系抗生物質に対し、過敏症の既往歴のある患者
- (2)本人又は両親、兄弟に気管支喘息、発疹、蕁麻疹等のアレルギー症状を起こしやすい体質を有する患者
- (3)高度の腎障害のある患者 (〈用法・用量に関連する使用上の注意〉及び「(薬物動態)」の項参照)
- (4)経口摂取の不良な患者又は非経口栄養の患者、全身状態の悪い患者 [ビタミンK欠乏症状があらわれることがあるので、観察を十分に行うこと。]
- (5)高齢者 (「(高齢者への投与)」の項参照)
- (6)本剤は生理食塩液100mLに溶解するため、次の患者には慎重に投与すること。

- 1) 心臓、循環器系機能障害のある患者 [循環血流量を増すことから心臓に負担をかけ、症状が悪化するおそれがある。]
- 2) 腎障害のある患者 [水分、塩化ナトリウムの過剰投与に陥りやすく、症状が悪化するおそれがある。]

*2. 重要な基本的注意

本剤によるショック、アナフィラキシーの発生を確実に予知できる方法がないので、次の措置をとるこ

- と。
- (1)事前に既往歴等について十分な問診を行うこと。
なお、抗生物質等によるアレルギー歴は必ず確認すること。
 - (2)投与に際しては、必ずショック等に対する救急処置のとれる準備をしておくこと。
 - (3)投与開始から投与終了後まで、患者を安静の状態に保たせ、十分な観察を行うこと。特に、投与開始直後は注意深く観察すること。

3. 相互作用

併用注意（併用に注意すること）

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
ワルファリン カリウム	ワルファリンカリウムの作用が増強されるおそれがある。ただし、本剤に関する症例報告はない。	腸内細菌によるビタミンKの産生を抑制することがある。
利尿剤 フロセミド 等	腎障害が増強されるおそれがある。	機序は明らかではないが、ラット、ウサギにおいて、腎障害が増強されるとの報告がある。

4. 副作用

本剤での臨床試験等では実施していないが、本剤を溶解したものはセファメジン注射用、筋注用と同一のものであるので、セファメジン注射用、筋注用での調査結果を以下に示す。

総症例84,799例（静注、点滴静注、筋注を含む）中、副作用（臨床検査値の変動を除く）は838例で発現頻度は0.99%であった。また、臨床検査値の変動のうち最も頻度が高かったのはAST(GOT)の上昇0.50% (222/44,143例)、次いでALT(GPT)の上昇0.49% (214/44,068例)であった。

(1971年8月～1982年4月までの集計)

(1)重大な副作用

- 1)ショック：ショック(0.1%未満)を起こすことがあるので、観察を十分に行い、不快感、口内異常感、喘鳴、眩暈、便意、耳鳴、発汗等があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- *2)アナフィラキシー：アナフィラキシー（呼吸困難、全身潮紅、血管浮腫、蕁麻疹等）(0.1%未満)があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 3)血液障害：汎血球減少(0.1%未満)、無顆粒球症(0.1%未満、初期症状：発熱、咽頭痛、頭痛、倦怠感等)、溶血性貧血(0.1%未満、初期症状：発熱、ヘモグロビン尿、貧血症状等)、血小板減少(0.1%未満、初期症状：点状出血、紫斑等)があらわれることがあるので、定期的に検査を行うなど観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 4)肝障害：黄疸(0.1%未満)、AST(GOT)、ALT(GPT)、AI-Pの上昇(各0.1～5%未満)等があらわれることがあるので、定期的に検査を行うなど観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

- *5)腎障害：急性腎障害等の重篤な腎障害(0.1%未満)があらわれることがあるので、定期的に検査を行うなど観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 6)大腸炎：偽膜性大腸炎等の血便を伴う重篤な大腸炎(0.1%未満)があらわれることがある。腹痛、頻回の下痢があらわれた場合には直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- *7)皮膚障害：中毒性表皮壊死融解症(Toxic Epidermal Necrolysis：TEN、0.1%未満)、皮膚粘膜眼症候群(Stevens-Johnson症候群、0.1%未満)があらわれることがあるので、観察を十分に行い、発熱、頭痛、関節痛、皮膚や粘膜の紅斑・水疱、皮膚の緊張感・灼熱感・疼痛等が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 8)間質性肺炎、PIE症候群：発熱、咳嗽、呼吸困難、胸部X線異常、好酸球増多等を伴う間質性肺炎、PIE症候群(各0.1%未満)等があらわれることがあるので、このような症状があらわれた場合には投与を中止し、副腎皮質ホルモン剤の投与等の適切な処置を行うこと。
- 9)痙攣：腎不全の患者に大量投与すると、痙攣等の神経症状(頻度不明)を起こすことがある²⁾。

(2)その他の副作用

	0.1～5%未満	0.1%未満
過敏症 ^{注)}	発疹、蕁麻疹、紅斑	そう痒、発熱、浮腫
血液	顆粒球減少、好酸球増多	
腎臓	BUN上昇	血清クレアチニン上昇
消化器	悪心、嘔吐	食欲不振、下痢
菌交代症		口内炎、カンジダ症
ビタミン欠乏症		ビタミンK欠乏症状(低プロトロンビン血症、出血傾向等)、ビタミンB群欠乏症状(舌炎、口内炎、食欲不振、神経炎等)
その他		頭痛、めまい、全身倦怠感

注)発現した場合には、投与を中止し、適切な処置を行うこと。

5. 高齢者への投与

高齢者には次の点に注意し、用量並びに投与間隔に留意するなど患者の状態を観察しながら、慎重に投与すること。

- (1)高齢者では生理機能が低下していることが多く、副作用が発現しやすい。
- (2)高齢者ではビタミンK欠乏による出血傾向があらわれることがある。

6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- (1)妊婦等：妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。]
- (2)授乳婦：授乳中の婦人への投与は避けることが望ましいが、やむを得ず投与する場合は、授乳を避けさせること。[母乳中へ移行することが報告されている。]（「薬物動態」の項参照）

7. 小児等への投与

低出生体重児、新生児に対する安全性は確立してい

ない。(使用経験が少ない。)

なお、低出生体重児、新生児では乳児、幼児等と比べて血清中濃度半減期が延長するとの報告がある。

(「薬物動態」の項参照)

8. 臨床検査結果に及ぼす影響

- (1) テステープ反応を除くベネディクト試薬、フェーリング試薬、クリニテストによる尿糖検査では偽陽性を呈することがあるので注意すること。
- (2) 直接クームス試験陽性を呈することがあるので注意すること。

9. 適用上の注意

(1) 投与時：

- 1) 静脈内大量投与により、血管痛、血栓性静脈炎を起こすことがあるので、これを予防するために注射液の調製、注射部位、注射方法等について十分注意し、その注射速度はできるだけ遅くすること。
- 2) 溶解後は分割投与しないこと。

- (2) 調製方法：溶解後は室温又は冷蔵庫保存で48時間以内に使用すること。

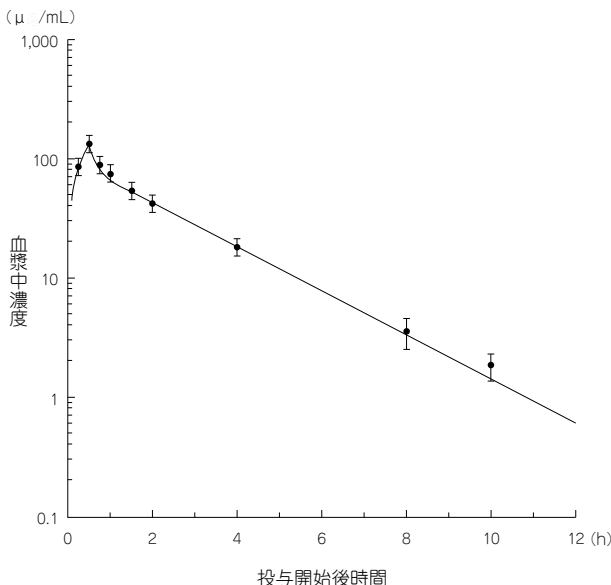
- (3) 調製時：ガベキサートメシル酸塩、ナファモスタットメシル酸塩、シメチジン、ファモチジン、アミノ糖系抗生物質と混合すると混濁することがある。

【薬物動態】

本剤での臨床試験は実施していないが、本剤を溶解したものはセファメジン注射用、筋注用と同一のものであるので、セファメジン注射用、筋注用の成績を以下に示す。

1. 血中濃度

- (1) 成人：健康成人に1gを30分で点滴静注すると、血漿中濃度は点滴終了直後にピーク値131 $\mu\text{g}/\text{mL}$ に達し、その半減期は2.46時間であった³⁾。また、2gを30分及び1時間で点滴静注すると、血清中濃度は点滴終了直後にそれぞれピーク値228 $\mu\text{g}/\text{mL}$ 、172 $\mu\text{g}/\text{mL}$ を示した⁴⁾。



健康成人男子に cefazolin 1g を 30 分かけて定速静注したときの血漿中濃度推移 (平均±S.D., n=8)

- (2) 腎機能障害のある患者では、腎障害の程度に応じて血清中濃度半減期が延長し、血清中濃度は持続した⁵⁾。

500mg 静注時の血清中濃度半減期及び尿中回収量

腎機能	GFR (mL/min)	例数	t _{1/2} (h)	尿中回収量(9h)
正常	—	3	1.6	420.8mg
中等度障害	28~75	3	2.7	166.7mg
高度障害	7.3~20	3	14.9	50.2mg

- (3) 低出生体重児、新生児及び小児⁶⁾：低出生体重児、新生児及び小児に25mg/kg静注した際の血清中濃度半減期は、低出生体重児、新生児で2.3~5.1時間、乳児、幼児、学童では1.3~2.2時間であった。なお、低出生体重児、新生児、乳児、幼児、学童の血清中濃度の推移は次表のとおりである。

低出生体重児 (≤2,500g)

日齢	例数	30分	1時間	2時間	4時間	6時間
≤3日	5	97	89.2	78	58.7	44.7
4~7日	8	99.0	97.8	83	56.8	40.2
≥8日	7	100.5	91.4	67.9	47.5	31.8

新生児

日齢	例数	30分	1時間	2時間	4時間	6時間
≤3日	14	122.4	119	101.2	79.1	58
4~7日	2	93	85	70	34	20
≥8日	3	95.5	79.3	54.8	29.7	17.8

乳児、幼児、学童

	例数	15分	30分	1時間	2時間	4時間	6時間
乳児	5	—	90.4	75.2	54.3	28.1	16.5
幼児	4	131	114	81.3	38.9	11.4	7.4
学童	4	160.8	120.5	79.1	51.8	18.8	9.5

2. 組織内移行：患者喀痰中⁷⁾、胸水中⁸⁾、胆汁中⁹⁾等への体液中移行、扁桃組織¹⁰⁾、胆嚢組織⁹⁾、子宮組織¹¹⁾、骨組織¹²⁾等への組織内移行は良好である。
3. 乳汁中移行：授乳婦20例に2g静注したときの母乳中濃度は静注後2時間目1.3±0.9 $\mu\text{g}/\text{mL}$ 、3時間目1.5±0.2 $\mu\text{g}/\text{mL}$ 、4時間目1.2±1.0 $\mu\text{g}/\text{mL}$ であった¹³⁾。
4. 代謝：尿中には抗菌代謝物質は認められていない¹⁴⁾。
5. 排泄：主として腎臓より排泄され、健康成人に1gを30分で点滴静注したときの投与後8時間までの尿中排泄率³⁾は投与量の88.7%で、2gを点滴静注したときの尿中排泄率⁴⁾は30分点滴で86.3% (投与後6.5時間まで)、1時間点滴で88.2% (投与後7時間まで)と良好である。

【臨床成績】

本剤での臨床試験は実施していないが、本剤を溶解したものはセファメジン注射用、筋注用と同一のものであるので、セファメジン注射用、筋注用の成績を以下に示す。

比較試験(呼吸器感染症¹⁵⁾、尿路感染症¹⁶⁾)及び一般臨床試験¹⁷⁾(静注、点滴静注、筋注を含む)における疾患別有効率は以下のとおりである。

疾患名	有効例/症例数	有効率 (%)	
敗血症	6/9	66.7	
感染性心内膜炎	3/5	60.0	
皮膚感染症	表在性皮膚感染症 (毛嚢炎)	2/5	40.0
	深在性皮膚感染症 (ひょう疽、せつ、カルブンケル、丹毒、フレグモネ等)	64/78	82.1
	リンパ管・リンパ節炎	15/22	68.2
	慢性膿皮症 (粉瘤、膿瘍)	13/19	68.4
外科・整形外科領域感染症	外傷・熱傷及び手術創等の二次感染	26/33	78.8
	びらん・潰瘍の二次感染 (潰瘍、褥瘡)	2/3	—
	乳腺炎	9/11	81.8
	骨髓炎	6/6	100
	関節炎	3/3	—
	咽喉・喉頭炎	8/11	72.7
呼吸器感染症	扁桃炎	46/48	95.8
	急性気管支炎、慢性呼吸器病変の二次感染 (慢性気管支炎、気管支拡張症、慢性呼吸器疾患の二次感染)	73/89	82.0
	肺炎	163/194	84.0
	肺膿瘍	14/22	63.6
	膿胸	9/13	69.2

疾患名		有効例/ 症例数	有効率 (%)
腎盂腎炎		105/149	70.5
腹膜炎(腹膜炎、骨盤腹膜炎)		35/43	81.4
胆嚢炎、胆管炎		48/55	87.3
婦人科 感染症	バルトリン腺炎	2/2	—
	子宮内感染(子宮内感染、子宮頸管炎、子宮内膜炎)	29/39	74.4
	子宮旁結合織炎	6/13	46.2
	全眼球炎	1/3	—
耳鼻科 感染症	中耳炎	51/63	81.0
	副鼻腔炎	1/3	—
	化膿性唾液腺炎(顎下腺炎、化膿性耳下腺炎)	3/3	—

【薬効薬理】

本剤での薬理試験等は実施していないが、本剤を溶解したものはセファメジン注射用、筋注用と同一のものであるので、セファメジン注射用、筋注用の成績を以下に示す。

1. 抗菌作用：抗菌スペクトルはグラム陽性菌、グラム陰性菌の広範囲にわたっており、特にグラム陽性球菌ではブドウ球菌属、レンサ球菌属、肺炎球菌、グラム陰性桿菌では、大腸菌、肺炎桿菌、プロテウス・ミラビリス、プロピデンシア属に優れた抗菌力を示す。作用形式は殺菌的である^{14)18)~20)}。
2. 作用機序：作用機序は細菌細胞壁の合成阻害であり、ペニシリン結合蛋白(PBP)に強い結合親和性を有する。

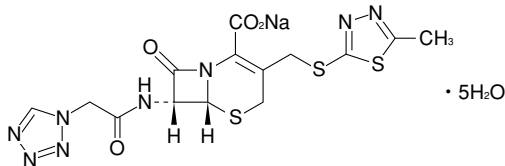
【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：セファゾリンナトリウム水和物

(Cefazolin Sodium Hydrate) 略号：CEZ

化学名：Monosodium(6*R*,7*R*)-3-(5-methyl-1,3,4-thiadiazol-2-ylsulfanylmethyl)-8-oxo-7-[2-(1*H*-tetrazol-1-yl)acetylamino]-5-thia-1-azabicyclo[4.2.0]oct-2-ene-2-carboxylate pentahydrate

構造式：



分子式：C₁₄H₁₃N₈NaO₅S₃ · 5H₂O

分子量：566.57

融点：明確な融点を示さない。

分配係数：(1-オクタノール/水系)

pH 1	3.30 × 10 ⁻¹	pH 7	3.45 × 10 ⁻⁴
pH 3	4.38 × 10 ⁻²	pH 9	2.90 × 10 ⁻⁴
pH 5	3.96 × 10 ⁻³		

性状：セファゾリンナトリウム水和物は白色～微帯黄白色の結晶である。水に溶けやすく、メタノールにやや溶けにくく、エタノール(95)に溶けにくく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。

【取扱い上の注意】

1. 注射液の調製法

カバーシートをはがし、溶解液(生理食塩液)部分を手で押して隔壁を開通させ、溶解液部分を繰り返し押し続けて完全に溶解する。(詳しい溶解操作方法については、バッグ製品の外袋及びカバーシートに記載の「溶解操作方法」を参照)

2. 溶解操作方法

(1)キットのカバーシートをはがして薬剤を確認する。



(2)溶解液部分を手で押して隔壁を開通させ、更に溶解液部分を繰り返し押し続けて薬剤を完全に溶解する。



【包装】

1g(力価)：10キット

2g(力価)：10キット

【主要文献及び文献請求先】

1. 主要文献

- 1) 厚生労働省健康局結核感染症課編：抗微生物薬適正使用の手引き
- 2) Bechtel, T.P. et al. : Am. J. Hosp. Pharm. 37 (2) : 271, 1980 [CEZ-01979]
- 3) 入江 伸 他：化学療法の領域 15 (5) : 766, 1999 [CEZ-04121]
- 4) 石川羊男 他：診療と新薬 15 (4) : 919, 1978 [CEZ-01166]
- 5) 木下康民 他：日本化学療法学会雑誌 18 (5) : 604, 1970 [CEZ-00254]
- 6) 堀 誠 他：母子化学療法研究の歩み p.64, 1979 [CEZ-01753]
- 7) 松本慶蔵 他：日本化学療法学会雑誌 18 (5) : 552, 1970 [CEZ-00246]
- 8) 清水辰典 : Jpn. J. Antibiot. 31 (2) : 108, 1978 [CEZ-01191]
- 9) 田村 隆 他：日本臨床外科医学会雑誌 43 (12) : 1325, 1982 [CEZ-02781]
- 10) 三好豊二 他：耳鼻咽喉科臨床 73 (11) : 1719, 1980 [CEZ-02259]
- 11) 山田順常 他：産婦人科の世界 29 (5) : 601, 1977 [CEZ-00876]
- 12) 藤巻有久 他：新薬と臨床 28 (12) : 2091, 1979 [CEZ-01944]
- 13) 長 和彦 他：日本新生児学会雑誌 15 (1) : 231, 1979 [CEZ-01756]
- 14) 西田 実 他：日本化学療法学会雑誌 18 (5) : 481, 1970 [CEZ-00237]
- 15) 中川圭一 他：感染症学雑誌 46 (6) : 210, 1972 [CEZ-00112]
- 16) 青河寛次 他：Jpn. J. Antibiot. 25 (2) : 72, 1972 [CEZ-00097]
- 17) 日本化学療法学会雑誌 18 (5), 1970 Cefazolin 論文特集号を中心に集計
- 18) 上田 泰 他：日本化学療法学会雑誌 18 (5) : 564, 1970 [CEZ-00248]
- 19) Sabath, L.D. et al. : J. Infect. Dis. 128 (Suppl.) : S320, 1973 [CEZ-00031]
- 20) 松本佳巳 他：Pharma Med. 20 (5) : 168, 2002 [CEZ-04348]

2. 文献請求先・製品情報お問い合わせ先

LTLファーマ株式会社 コールセンター
〒160-0023 東京都新宿区西新宿6丁目10番1号
☎ 0120-303-711

製造販売

LTLファーマ株式会社
東京都新宿区西新宿6丁目10番1号

CMK1100

